

(19)世界知的所有権機関  
国際事務局(43)国際公開日  
2005年3月10日 (10.03.2005)

PCT

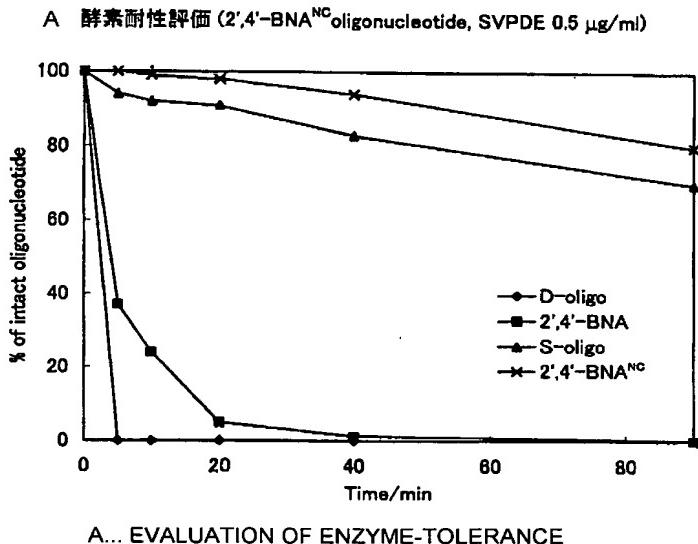
(10)国際公開番号  
WO 2005/021570 A1

- (51) 国際特許分類<sup>7</sup>: C07H 19/04, 21/00  
 (21) 国際出願番号: PCT/JP2004/012173  
 (22) 国際出願日: 2004年8月25日 (25.08.2004)  
 (25) 国際出願の言語: 日本語  
 (26) 国際公開の言語: 日本語  
 (30) 優先権データ:  
 特願2003-304847 2003年8月28日 (28.08.2003) JP  
 (71) 出願人および  
 (72) 発明者: 今西 武 (IMANISHI, Takeshi) [JP/JP]; 〒6310045 奈良県奈良市千代ヶ丘2丁目2-18 Nara (JP).
- (72) 発明者; および  
 (75) 発明者/出願人(米国についてのみ): 小比賀聰 (OBIKA, Satoshi) [JP/JP]; 〒5691022 大阪府高槻市日吉台四番町2034 Osaka (JP). 宮下 和之 (MIYASHITA, Kazuyuki) [JP/JP]; 〒5620044 大阪府箕面市半町2丁目22番10号 Osaka (JP).  
 (74) 代理人: 杜本一夫, 外 (SHAMOTO, Ichio et al.); 〒1000004 東京都千代田区大手町二丁目2番1号 新大手町ビル206区 エアサハラ法律特許事務所 Tokyo (JP).  
 (81) 指定国(表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,

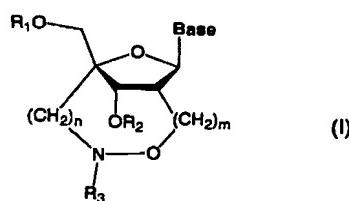
[続葉有]

(54) Title: NOVEL ARTIFICIAL NUCLEIC ACIDS OF N-O BOND CROSSLINKAGE TYPE

(54)発明の名称: N-O結合性架橋構造型新規人工核酸



(57) Abstract: It is intended to provide oligonucleotide analogs usable in, for example, the antisense method which are highly tolerant to enzymes, have a strong and selective binding affinity for a single-stranded RNA and also are highly capable of forming a triple-strand in a double-stranded DNA, and nucleoside analogs useful for producing the same. Namely, a nucleoside analog which is a compound represented by the following general formula (I) or its salt and an oligonucleotide analog containing one or more of the same: [Chemical formula 1] (I) wherein Base represents an optionally substituted aromatic heterocyclic group, etc.; R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub> and R<sub>3</sub> represent each a hydrogen atom, an amino-protecting group, a hydroxyl-protecting group, a phosphate group or -P(R<sub>4</sub>)R<sub>5</sub> [wherein R<sub>4</sub> and R<sub>5</sub> represent each a hydroxyl group, a protecting group, an optionally protected mercapto group, etc.]; m is from 0 to 2; and n is from 1 to 3.



WO 2005/021570 A1

[続葉有]



ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

- (84) 指定国(表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF,

BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

#### 添付公開書類:

- 國際調査報告書
- 電子形式により別個に公開された明細書の配列表部分、請求に基づき國際事務局から入手可能

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

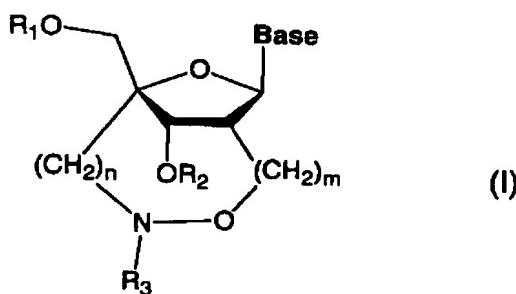
---

#### (57) 要約:

アンチセンス法などに有用な、優れた酵素耐性を有し、一本鎖RNAへの強い選択的結合親和性を有し、更に二本鎖DNAに対する優れた三重鎖形成能を有するオリゴヌクレオチド類縁体、及びこれを製造するために有用なヌクレオシド類縁体を提供するものである。

一般式(I)で表される化合物及びその塩であるヌクレオシド類縁体及びこれを1個以上含むオリゴヌクレオチド類縁体。

#### 【化1】



(式中、Baseは、置換基を有していてもよい芳香族複素環基など;R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>は、水素原子、アミノ基の保護基、水酸基の保護基、リン酸基、-P(R<sub>4</sub>)<sub>2</sub>R<sub>5</sub>〔式中、R<sub>4</sub>およびR<sub>5</sub>は、水酸基、保護された水酸基、メルカプト基、保護されたメルカプト基など〕;m=0~2;n=1~3を示す。)